Rec'd PCT/PTO 15 JUL 2005





INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

anslation	INTERNATIO	NAL PRELIMINA	RY EXAMI	NATION REPORT	
		(PCT Article 36	and Rule 70)	•	
Applicant's or agent's 2153/D	l l	FOR FURTHER ACTI		ification of Transmittal of Internation of Examination Report (Form PCT/IPEA/4	
International application	on No.	International filing date (-	1	
PCT/EP200 International Patent Cla A61K 9/00, 9	assification (IPC) or nat	21 November 2003 ional classification and II	<u>` </u>	28 January 2003 (28.01.2003	
Applicant .		RÖHM GMBH (ե CO. KG		
 This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36. This REPORT consists of a total of5 sheets, including this cover sheet. 					
This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have be amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rt 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT). These annexes consist of a total of sheets.					
3. This report contains indications relating to the following items:					
I Basis of the report					
II Priority					
III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability					
IV Lack of unity of invention					
Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement					
VI Certain documents cited					
VII Certain defects in the international application					
VIII 🗌	Certain observations	on the international appli	eation		
Date of submission of	f the demand	ľ	ate of completic	on of this report	
02 .	July 2004 (02.07.20	04)	04	November 2004 (04.11.2004)	
Name and mailing ad	dress of the IPEA/EP		uthorized office	r	
Facsimile No. Telephone No.					

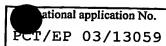


INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No. PCT/EP2003/013059

1. With regard to the elements of the international application: the international application as originally filed the description: pages
the international application as originally filed the description: pages
the description: pages
pages
pages
the claims: pages 1-9 , as originally file pages , filed with the letter of pages , as amended (together with any statement under Article I pages , filed with the letter of the drawings: pages , filed with the letter of the drawings: pages , as originally file pages , filed with the letter of filed with the deman pages , filed with the letter of the sequence listing part of the description: pages , filed with the letter of filed with the letter of filed with the deman pages , as originally file pages , filed with the deman pages , filed with the letter of filed with the deman pages , filed with the deman pages , filed with the letter of filed
the claims: pages
pages
pages
pages
pages
the drawings: pages
pages
pages
pages
the sequence listing part of the description: pages
pages
pages
2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item. These elements were available or furnished to this Authority in the following language which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)). The language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)). The language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and or 55.3). With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing: contained in the international application in written form.
 With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which is the international application was filed, unless otherwise indicated under this item. These elements were available or furnished to this Authority in the following language
furnished subsequently to this Authority in written form. furnished subsequently to this Authority in computer readable form. The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished. The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished. The amendments have resulted in the cancellation of: the description, pages
the claims, Nos.
the drawings, sheets/fig
This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**
* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16
** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRINCE INARY EXAMINATION REPORT



V.	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
----	---

Statement			
Novelty (N)	Claims	1-9	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-9	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-9	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

Reference is made to the following documents:

D1: EP-A-0 417 588 (ROEHM GMBH) 20 March 1991 (1991 - 03 - 20)

D2: WO-A-03/007917 (SUPLIE PASCAL; CRIERE BRUNO (FR); NOURI NOURREDINE (FR); ZUCCARELLI J)

30 January 2003 (2003-01-30)

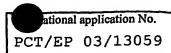
D3: US-A1-2002/168404 (RAULT ISABELLE ET AL) 14 November 2002 (2002-11-14).

1. Novelty and inventive step

The present application complies with the requirements of PCT Article 33(1), because the subject matter of claims 1-9 appears to be novel within the meaning of PCT Article 33(2).

The present application describes a method for producing an oral drug form which immediately disintegrates and releases the active ingredient in the mouth, consisting of an anionic active ingredient, an acrylic and/or methacrylic copolymer and 5 to 50 wt.%, in relation to the polymer, of a C_{12} to C_{22} carboxylic acid, by means of intensive mixing in the melt, solidification of the mixture and grinding to a powder with a mean particle size of 200 micrometres which contains the active ingredient,

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT



followed by embedding of the powder in a watersoluble matrix. The powder containing the active ingredient and the uses thereof are also disclosed.

None of the cited documents describes a method or a powder which has the above-mentioned properties or compositions. In particular, the disclosure of the cited documents does not include the above-mentioned C_{12} to C_{22} carboxylic acid.

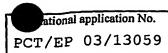
D1, for instance, describes: production and use of a complexed drug, an ionogenic active ingredient being reacted with a complementary ionogenic polymer (acrylic or methacryic copolymer). However, the addition of a C_{12} to C_{22} carboxylic acid is not included.

D2 discloses: pharmaceutical formulation consisting of a methacrylic polymer and a proton pump inhibitor and additional pharmaceutical additives. However, a C_{12} to C_{22} carboxylic acid is not included.

 ${f D3}$ describes: use of acrylic polymers as a disintegrating agent and taste masker. However, not with a C_{12} to C_{22} carboxylic acid.

None of the cited documents D1 to D3 describes the use of an acrylic and/or methacrylic copolymer for complexing an anionic active ingredient in combination with a C_{12} to C_{22} carboxylic acid. For this reason, the disclosure of the present application is considered to be novel and inventive in relation to the prior art.





2. Industrial applicability

Claims 1-9 of the present application are all considered to be industrially applicable.

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWES

PCT Rec'd PCT/PTO 15 JUL 2005 INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

REC'D 0 5 NOV 2004

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 2153/Dr.Got/	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des Grienationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)						
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/13059	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monati/Jahr) Prioritätsdatum (Tag/Monati/Jahr) 28.01.2003						
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK							
A61K9/00, A61K9/08							
·							
Anmelder R\HM GMBH & CO. KG							
HI IN GIVIDIT & CO. NO							
1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.							
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesa	amt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.						
· ·							
Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).							
Diese Anlagen umfassen insges	Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.						
3. Dieser Bericht enthält Angaben a	zu folgenden Punkten:						
	Grundlage des Bescheids						
1	Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung						
gewerblichen Anwen	Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung						
VIII LI Bestimmte Bemerkui	VIII D Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung						
Datum der Einreichung des Antrags	Datum der Fertigstellung dieses Berichts						
02.07.2004	04.11.2004						
Name und Postanschrift der mit der Internationalen Prüfung Bevollmächtigter Bediensteter							
beauftragten Behörde Europäisches Patentamt							
D-80298 München Felder, C							
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465 Tel. +49 89 2399-7852							

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER **PRÜFUNGSBERICHT**

PCT/EP 03/13059 Internationales Aktenzeichen

	Gru	ndlage des Berichts		•	• •		
1.	Auff	Hinsichtlich der Bestandteile der internationalen Anmeldung <i>(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine</i> Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich Bingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)):					
Beschreibung, Seiten							
1-24 ir			in der ursprünglich eing	ereichten Fassung			
Ansprüche, Nr.			•	•	: 1		
	1-9		in der ursprünglich eing	ereichten Fassung			
2.	Hinsichtlich der Sprache: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.						
	Die eing	Bestandteile standen gereicht; dabei handel	der Behörde in der Sprache: t es sich um:	zur Verfügung bzw	v. wurden in dieser Spra	ache	
		die Sprache der Übe (nach Regel 23.1(b))	rsetzung, die für die Zwecke de	r internationalen Re	cherche eingereicht wo	rden ist	
		die Veröffentlichungs	ssprache der internationalen An	meldung (nach Rege	el 48.3(b)).	-	
		die Sprache der Übe worden ist (nach Reg	rsetzung, die für die Zwecke de gel 55.2 und/oder 55.3).	r internationalen vor	läufigen Prūfung einge	reicht ·	
3.	Hin: inte	sichtlich der in der inte rnationale vorläufige l	ernationalen Anmeldung offenb Prüfung auf der Grundlage des	arten Nucleotid- un Sequenzprotokolls c	<mark>d/oder Aminosäurese</mark> lurchgeführt worden, da	quenz ist die as:	
		in der internationaler	n Anmeldung in schriftlicher For	m enthalten ist.		: .	
		zusammen mit der ir	nternationalen Anmeldung in co	mputerlesbarer Forn	n eingereicht worden is	t. :	
		bei der Behörde nac	hträglich in schriftlicher Form ei	ngereicht worden ist			
☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbare				orm eingereicht word	den ist.	•	
	□.	Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.					
		Die Erklärung, daß d Sequenzprotokoll er	lie in computerlesbarer Form er Itsprechen, wurde vorgelegt.	fassten Informatione	en dem schriftlichen	. , , i.	
4.	Auf	grund der Änderunge	n sind folgende Unterlagen forte	gefallen:	. (: ·	
		Beschreibung,	Seiten:				
		Ansprüche,	Nr.:		·		
		Zeichnungen,	Blatt:		¥		
5.		Dieser Bericht ist oh angegebenen Gründ	ne Berücksichtigung (von einige den nach Auffassung der Behör	en) der Änderungen de über den Offenba	erstellt worden, da dies arungsgehalt in der urs	se aus den orünglich	

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht

beizufügen.)

eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/13059

- 6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:
- V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)

Ja: Ansprüche 1-9

Nein: Ansprüche

Erfinderische Tätigkeit (IS)

Ja: Ansprüche 1-9

Nein: Ansprüche

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)

Ja: Ansprüche: 1-9

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

- D1: EP-A-0 417 588 (ROEHM GMBH) 20. März 1991 (1991-03-20)
- D2: WO 03/007917 A (SUPLIE PASCAL; CRIERE BRUNO (FR); NOURI NOURREDINE (FR); ZUCCARELLI J) 30. Januar 2003 (2003-01-30)
- D3: US 2002/168404 A1 (RAULT ISABELLE ET AL) 14. November 2002 (2002-11-14)

Neuheit und erfinderische Tätigkeit 1.

Die vorliegende Anmeldung erfüllt die Erfordernisse des Artikels 33(1) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-9 im Sinne von Artikel 33(2) PCT neu zu sein scheint.

Die vorliegende Anmeldung beschreibt ein Verfahren zur Herstellung einer oralen Arzneiform mit unmittelbarem Zerfall und Wirkstofffreisetzung bereits im Mund bestehendem aus einem anionischen Wirkstoff, einem Acrylat- und/oder Methacrylatcoploymer sowie 5 bis 50 Gew.-% bezogen auf das Polymer einer C₁₂ bis C₂₂ Carbonsäure, mittels intensivem Mischen in der Schmelze, Erstarren der Mischung und Mahlen zu einem wirkstoffhaltigen Pulver mit einer mittleren Korngrösse von 200 micrometer und anschliessendes Einbetten des Pulvers in eine wasserlösliche Matrix. Des weiteren wird das wirkstoffhaltige Pulver sowie dessen Verwendungen offenbart.

Keines der zitierten Dokumente beschreibt ein Verfahren oder ein Pulver, welches die oben erwähnten Eigenschaften oder Zusammensetzungen hat. Im speziellen fehlt der Offenbarung der zitierten Dokumente die bereits erwähnte C₁₂ bis C₂₂ Carbonsäure.

So beschreibt D1: Herstellung und Verwendung eines komplexierten Arzneimittels, wobei ein ionogener Wirkstoff mit einem komplementär ionogenen

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT - BEIBLATT

Polymer (Acryl- oder Methacrylcopolymer) umgesetzt wird. Jedoch fehlt die Zugabe einer C_{12} bis C_{22} Carbonsäure.

D2 offenbart: Pharmazeutische Formulierung bestehend aus einem Methacrylate-Polymer und einem Protonenpumpen-Inhibitor und weiteren pharmazeutischen Hilfsstoffen. Jedoch ohne eine C₁₂ bis C₂₂ Carbonsäure. D3 beschreibt: Gebrauch von Acrylpolymeren als Zerfallsstoff und Geschmacksmaskierer. Jedoch nicht mit einer C₁₂ bis C₂₂ Carbonsäure.

Keines der zitierten Dokumente D1-D3 beschreibt die Verwendung eines Acrylatund/oder Methacrylatcoploymer zur Komplexierung eines anionischen Wirkstoffs in Kombination mir einer C₁₂ bis C₂₂ Carbonsäure. Aus diesem Grund wird die Offenbarung der vorliegenden Anmeldung gegenüber dem Stand der Technik als neu und erfinderisch angesehen.

2. Industrielle Anwendbarkeit

Die Ansprüche 1-9 der vorliegenden Anmeldung werden alle als industriell anwendbar angesehen.